## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# A LANGE BUNGER IN BIBLIO 1990 BEING BEING BUILD BO AN EBEILD BUNG HEIGE BINGE BUNG BEING BEING HEIGT HEIGT HEF

### (43) 国際公開日 2005 年4 月28 日 (28.04.2005)

**PCT** 

## (10) 国際公開番号 WO 2005/037268 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/203, 9/51, 9/06, 9/70, 7/00, 7/48, A61P 17/00, 3/02

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2003/013181

(22) 国際出願日:

2003年10月15日(15.10.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社LTTパイオファーマ (LTT BIO-PHARMA CO.,LTD.) [JP/JP]; 〒105-6201 東京都港区愛宕 2 丁目5番1号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山口 葉子 (YA-MAGUCHI, Yoko) [JP/JP]; 〒258-0022 神奈川県 足柄

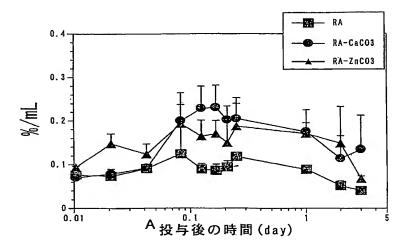
上郡開成町 牛島 2 7-1 7 Kanagawa (JP). 五十嵐 理 慧 (IGARASHI,Rie) [JP/JP]; 〒214-0036 神奈川県 川崎 市多摩区 南生田 5 丁目 8-2 Kanagawa (JP). 水島 裕 (MIZUSHIMA,Yutaka) [JP/JP]; 〒106-0032 東京都港 区六本木 6 丁目 1 2-3-2 4 0 2 Tokyo (JP). 武永美 津子 (TAKENAGA,Mitsuko) [JP/JP]; 〒216-0015 神奈 川県 川崎市宮前区 菅生 2 丁目 3 0-1 Kanagawa (JP). 中村 なつみ (NAKAMURA,Natsumi) [JP/JP]; 〒216-0005 神奈川県 川崎市宮前区土橋 7 丁目 1-5-1 1 1 Kanagawa (JP).

- (74) 代理人: 草間 攻 (KUSAMA,Osamu); 〒102-0072 東京都 千代田区飯田橋 4 丁目 5 番 1 2 号 岩田ビル 7 階草間特許事務所 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR,

/続葉有/

(54) Title: COMPOSITION CONTAINING RETINOIC ACID NANOPARTICLES COATED WITH POLYVALENT METAL INORGANIC SALT

(54) 発明の名称: 多価金属無機塩被覆レチノイン酸ナノ粒子含有組成物



#### A... TIME (DAYS) AFTER ADMINISTRATION

(57) Abstract: It is intended to provide a composition containing, as the active ingredient, retinoic acid nanoparticles having relieved irritation, which can be subcutaneously and intravenously administered, is usable as a sustained release preparation, and has such a high skin-permeability as allowing the use thereof as an external preparation such as a drug or a quasi drug as well as a cosmetic to be applied to the skin, etc. When dissolved in water, the retinoic acid nanoparticles coated with a polyvalent metal inorganic salt, i.e., the active ingredient, are maintained in the form of a transparent solution and, therefore, can be administered as a subcutaneous or intravenous injection. Since retinoic acid is coated with a polyvalent metal inorganic salt film, these nanoparticles are characterized by showing relieved irritation and thus causing neither inflammation nor canceration at administration site. As the polyvalent metal inorganic salt, use is made of calcium carbonate, zinc carbonate or calcium phosphate.

#### 

LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),

OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 添付公開書類:

#### 一 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約: 皮下投与および静脈内投与が可能であり、徐放性製剤としても使用でき、さらに皮膚透過性が高く、皮膚に塗布等をする医薬品および医薬部外品としての外用剤および化粧品にも使用できる、刺激性が低減されたレチノイン酸のナノ粒子を有効成分として含有する組成物を提供する。本発明の有効成分である多価金属無機塩被覆レチノイン酸ナノ粒子は、水に溶解した場合には透明溶液の形態を保っているため、皮下および静脈内注射製剤として投与することが可能となる。また、多価金属無機塩の皮膜によりレチノイン酸が被覆されていることから低刺激性であり、投与部位における炎症の発生、腫瘍化などがみられない特性を有している。その多価金属無機塩としては、炭酸カルシウム、炭酸亜鉛またはリン酸カルシウムである。